PCT WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM Internationale ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation 6:

(11) Internationale Veröffentlichungsnummer:

WO 99/62478

A61K 7/48

A1

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum:

9. Dezember 1999 (09.12.99)

(21) Internationales Aktenzeichen:

PCT/EP99/03777

(22) Internationales Anmeldedatum:

1. Juni 1999 (01.06.99)

(30) Prioritätsdaten: 198 24 727.3

3. Juni 1998 (03,06.98)

DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BEIERS-DORF AG [DE/DE]; Unnastrasse 48, D-20245 Hamburg

(72) Erfinder; und

- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SCHREINER, Volker [DE/DE]; Eimsbütteler Chaussee 67, D-20259 Hamburg (DE). SCHÖNROCK, Uwe [DE/DE]; Lerchenweg 33, D-23866 Nahe (DE). STÄB, Franz [DE/DE]; Bäckerstrasse 3. D-21379 Echem (DE), MAX, Heiner [DE/DE]; Krochmannstrasse 82 b, D-22297 Hamburg (DE). SAND-HOFF, Konrad [DE/DE]; Auf dem Platt 12, D-53347 Alfter (DE). DÖRING, Thomas [DE/DE]; Kreuzfeldstrasse 12, D-53773 Hennef (DE).
- (74) Gemeinsamer Vertreter: BEIERSDORF AG; Unnastrasse 48, D-20245 Hamburg (DE).

(81) Bestimmungsstaaten: JP, US, europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).

Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.

Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist; Veröffentlichung wird wiederhalt falls Anderungen

- (54) Title: COSMETIC OR DERMATOLOGIC PREPARATIONS CONTAINING CATECHINS OR GREEN TEA EXTRACT
- (54) Bezeichnung: KOSMETISCHE ODER DERMATOLOGISCHE ZUBEREITUNGEN MIT EINEM GEHALT AN CATECHINEN ODER EINEM GEHALT AN EXTRAKT VON GRÜNEM TEE

(57) Abstract

The invention relates to the use of catechins or bile acid esters of catechin or aqueous or organic extracts from plants or plant parts which contain catechins or bile acid esters of catechins, for example, of the leaves of the plant family Theaceae, especially of the species Camellia sinensis (green tea) or typical constituents thereof (such as, e.g. polyphenols or catechins, caffeine, vitamins, sugar, minerals, amino acids, lipids) for the prophylaxis, treatment and/or care of dry skin conditions.

(57) Zusammenfassung

Verwendung von Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen oder wäßriger bzw. organischer Extrakte aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen aufweisen, beispielsweise den Blättern der Pflanzenfamille Theaceae, insbesondere der Spezies Camellia sinensis (grüner Tee) bzw. deren typische Inhaltsstoffe (wie z.B. Polyphenole bzw. Catechine, Coffein, Vitamine, Zucker, Mineralien, Aminosäuren, Lipide), zur Prophylaxe, Behandlung und/oder Pflege trockener Hautzustände.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

| l | | | | | | | |
|----|------------|----|-----------------------------|-----|-----------------------------|-----|------------------------|
| Al | . Albanien | ES | Spanien | LS. | Lesotho | SI | Slowenien |
| AN | | FL | Finnland | LT | Litauen | SK | Slowakei |
| A7 | | FR | Frankreich | LU | Luxemburg | SN | Senegal |
| AL | | GA | Gabun | LV | Lettland | SZ | Swasiland |
| AZ | | GB | Vereinigtes Königreich | MC | Monaco | TD | Tschad |
| B/ | | GE | Georgien | MD | Republik Moldau | TG | Togo |
| BE | | GH | Ghana | MG | Madagaskar | TJ | Tadschikistan |
| BE | | GN | Guinea | MK | Die ehemalige jugoslawische | TM | Turkmenistan |
| BF | _ | GR | Griechenland | | Republik Mazedonien | TR | Türkei |
| BC | | HU | Ungam | ML | Mali | TT | Trinidad und Tobago |
| BJ | , • | IE | Irland | MN | Mongolei | UA | Ukraine |
| BF | | IL | Israel | MR | Mauretanien | UG | Uganda |
| В | | IS | Island | MW | Malawi | US | Vereinigte Staaten von |
| C/ | *** | IT | Italien | MX | Mexiko | | Amerika |
| CF | | | Japan | NE | Niger | UZ | Usbekistan |
| CC | | KE | Kenia | NL | Niederlande | ·VN | Vietnam |
| CI | | KG | Kirgisistan | NO | Norwegen | YU | Jugoslawien |
| CI | | KP | Demokratische Volksrepublik | NZ | Neuseeland | zw | Zimbabwe |
| Ch | | | Korea | PL | Polen | | |
| CN | | KR | Republik Korea | PT | Portuga) | | |
| Č | | KZ | Kasachstan | RO | Rumanien | | |
| CZ | | LC | St. Lucia | RU | Russiache Föderation | | |
| DE | | ш | Liechtenstein | SD | Sudan . | | |
| DI | | LK | Sri Lanka | SE | Schweden | | |
| EF | | LR | Liberia | SG | Singapur | | |

WO 99/62478 PCT/EP99/03777

Beschreibung

Kosmetische oder dermatologische Zubereitungen mit einem Gehalt an Catechinen oder einem Gehalt an Extrakt von grünem Tee

Die vorliegende Erfindung betrifft kosmetische bzw. dermatologische dermatologische Zubereitungen, enthaltend Wirkstoffe zur Pflege und zum Schutze der Haut, insbesondere der empfindlichen und trockenen Haut wie auch ganz besonders im Vordergrunde stehend der durch intrinsische und/oder extrinsische Faktoren gealterten oder alternden Haut sowie die Verwendung solcher Wirkstoffe und Kombinationen solcher Wirkstoffe auf dem Gebiete der kosmetischen und dermatologischen Hautpflege.

Unter kosmetischer Hautpflege ist in erster Linie zu verstehen, daß die natürliche Funktion der Haut als Barriere gegen Umwelteinflüsse (z.B. Schmutz, Chemikalien, Mikroorganismen) und gegen den Verlust von körpereigenen Stoffen (z.B. Wasser, natürliche Fette, Elektrolyte) gestärkt oder wiederhergestellt wird.

Wird diese Funktion gestört, kann es zu verstärkter Resorption toxischer oder allergener Stoffe oder zum Befall von Mikroorganismen und als Folge zu toxischen oder allergischen Hautreaktionen kommen.

Ziel der Hautpflege ist es ferner, den durch tägliche Waschen verursachten Fett- und Wasserverlust der Haut auszugleichen. Dies ist gerade dann wichtig, wenn das natürliche Regenerationsvermögen nicht ausreicht. Außerdem sollen Hautpflegeprodukte vor Umwelteinflüssen, insbesondere vor Sonne und Wind, schützen und die Hautalterung verzögern.

Die Hornschicht der Haut zeichnet sich durch eine besondere Struktur aus, die einerseits die Haut vor Verlust an lebenswichtigem Zellwasser bzw. dem Eindringen von externen Noxen schützt und andererseits ihre eigene Flexibilität durch Bindung einer definierten Wassermenge stabilisiert: Interzellularlipide, bestehend aus freien Sterolen und Fettsäuren sowie verschiedenen Ceramidklassen, bilden innerhalb der Horn-

schicht eine Barriere in Form extrazellulärer, multilamellarer und wasserundurchlässiger Membransysteme aus.

Die Lipidmembranen umlagern die abgestorbenen Korneozyten mit eingelagerten hygroskopischen Stoffen. Die Hornschicht befindet sich in einem ständigen Erneuerungsprozess, wobei nach außen kontinuierlich feine Schuppen (Korneozyten mit anhaftenden Lipiden) abgegeben und von innen verhorntes Zell- und Lipidmaterial nachproduziert wird. Im Gleichgewicht verursacht der Regenerationsprozess also keine Veränderung des transepidermalen Wasserverlüstes.

Schon bei einem einfachen Wasserbade ohne Zusatz von Tensiden kommt es zunächst zu einer Quellung der Hornschicht der Haut, wobei der Grad dieser Quellung beispielsweise von der Dauer des Bades und dessen Temperatur abhängt. Zugleich werden wasserlösliche Stoffe, z.B. wasserlösliche Schmutzbestandteile, aber auch hauteigene Stoffe, die für das Wasserbindungsvermögen der Hornschicht verantwortlich sind, ab- bzw. ausgewaschen. Durch hauteigene oberflächenaktive Stoffe werden zudem auch Hautfette in gewissem Ausmaße gelöst und ausgewaschen. Dies bedingt nach anfänglicher Quellung eine nachfolgende deutliche Austrocknung der Haut, die durch waschaktive Zusätze nach verstärkt werden kann.

Bei gesunder Haut sind diese Vorgänge im allgemeinen belanglos, da die Schutzmechanismen der Haut solche leichten Störungen der oberen Hautschichten ohne weiteres kompensieren können. Aber bereits im Falle nichtpathologischer Abweichungen vom Normalstatus, z.B. durch umweltbedingte Abnutzungsschäden bzw. Irritationen, Lichtschäden, Altershaut usw., ist der Schutzmechanismus der Hautoberfläche gestört. Unter Umständen ist er dann aus eigener Kraft nicht mehr imstande, seine Aufgabe zu erfüllen und muß durch externe Maßnahmen regeneriert werden.

Darüber hinaus ist bekannt, daß Lipidzusammensetzung und -menge der Hornschicht der pathologisch veränderten, trockenen und der trockenen, jedoch nicht erkrankten Haut jüngerer und älterer Menschen vom Normalzustand abweicht, der in der gesunden, normal hydrierten Haut einer gleichalten Altersgruppe vorgefunden wird. Dabei stellen die Veränderungen im Lipidmuster der sehr trockenen, nicht-ekzematösen Haut von Patienten mit atopischem Ekzem einen Extremfall für die Abweichungen dar, die in der trockenen Haut hautgesunder Menschen vorgefunden werden.

Diese Abweichungen betreffen dabei ganz besonders die Ceramide, die in ihrer Menge stark reduziert und zusätzlich anders zusammengesetzt sind. Auffallend ist dabei in besonderer Weise das Defizit an den Ceramiden 1 und 3, wobei insbesondere für das Ceramid 1 bekannt ist, daß es in besonderer Weise die Ordnung der Lipide in den Interzellularmembransystemen steigert.

Nachteilige Veränderungen in den Lipidmembranen der vorab geschilderten Art beruhen möglicherweise auf fehlgesteuerter Lipidbiosynthese und erhöhen ebenfalls im Endeffekt den transepidermalen Wasserverlust. Eine langanhaltende Barriereschwäche wiederum macht die an sich gesunde Haut empfindlicher und kann im Einzellfalle zum Entstehen ekzematöser Vorgänge in der kranken Haut beitragen.

Die Wirkung von Salben und Cremes auf Barrierefunktion und Hydratation der Hornschicht besteht in der Regel nicht in einer Wiederherstellung bzw. Stärkung der physikalisch-chemischen Eigenschaften der Lamellen aus Interzellularlipiden. Ein wesentlicher Teileffekt beruht auf der bloßen Abdeckung der behandelten Hautbezirke und dem daraus resultierenden Wasserstau in der darunterliegenden Homschicht. Coapplizierte hygroskopische Substanzen binden das Wasser, so daß es zu einer meßbaren Zunahme des Wassergehaltes in der Hornschicht kommt. Diese rein physikalische Barriere kann jedoch relativ leicht wieder entfernt werden. Nach dem Absetzen des Produktes kehrt die Haut dann sehr schnell wieder den Zustand vor Behandlungsbeginn zurück. Darüber hinaus kann die Hautpflegewirkung bei regelmäßiger Behandlung nachlassen, so daß schließlich sogar während der Behandlung der Status quo wieder erreicht wird. Bei bestimmten Produkten verschlechtert sich der Zustand der Haut nach Absetzen unter Umständen vorübergehend. Eine nachhaltige Produktwirkung wird in der Regel also nicht oder nur in einem eingeschränkten Maße erreicht.

Um die defizitäre Haut bei ihrer natürlichen Regeneration zu unterstützen und ihre physiologische Funktion zu stärken, werden topischen Präparaten in neuerer Zeit zunehmend Interzellularlipidmischungen zugesetzt, die von der Haut zum Wiederaufbau der natürlichen Barriere verwendet werden sollen. Allerdings handelt es sich bei diesen Lipiden, insbesondere aber den Ceramiden, um sehr teure Rohstoffe. Zudem ist ihre Wirkung meist sehr viel geringer als erhofft.

Ziel der vorliegenden Erfindung war es somit. Wege zu finden, die Nachteile d s Standes der Technik zu vermeid n. Insbesondere sollte die Wirkung der Hautpflege-produkte physiologisch, schnell und nachhaltig sein.

Erfindungsgemäß werden diese Aufgaben gelöst durch Gegenstand der Erfindung sind ferner die Verwendung von Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen oder wäßriger bzw. organischer Extrakte aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen aufweisen, beispielsweise den Blättem der Pflanzenfamilie Theaceae, insbesondere der Spezies Camellia sinensis (grüner Tee) bzw. deren typische Inhaltsstoffe (wie z.B. Polyphenole bzw. Catechine, Coffein, Vitamine, Zucker, Mineralien, Aminosäuren, Lipide), zur Prophylaxe, Behandlung und/oder Pflege trockener Hautzustände.

Catechine stellen eine Gruppe von Verbindungen dar, die als hydrierte Flavone oder Anthocyanidine aufzufassen sind. Die Catechine bilden die Grundsubstanz einer Reihe natürlicher oligo- oder polymerer Gerbstoffe, z. B. im Tee. Sie kommen zusammen mit anderen Phenolen in vielen Obstarten vor und sind an der durch Phenoloxidasen katalysierten Bräunung von Druck- und Schnittstellen (z. B. bei Äpfeln) beteiligt.

Der Grundkörper, das "Catechin" (Catechol, 3,3',4',5,7-Flavanpentaol, 2-(3,4-Dihydroxyphenyl)-chroman-3,5,7-triol) ist weitverbreitet in Pflanzen und kommt beispielsweise im Catechu vor. Es ist durch die Strukturformel

gekennzeichnet.

Das Epicatechin ((2R,3R)-3,3',4',5,7-Flavanpentaol) stellt ein Epimeres des Catechins dar und ist durch die Strukturformel

gekennzeichnet.

Die erfindungsgemäßen Aufgaben werden ebenfalls gelöst durch kosmetische oder dermatologische Zubereitungen enthältend pflanzliche Auszüge mit einem Gehalt an Catechinen, insbesondere solche Zubereitungen, die Extrakte des grünen Tees enthalten.

Tee stammt ausschließlich aus Blättern, Blattknospen und zarten Stielen des Teestrauches (Camellia sinensis L.), die nach Verfahren wie Welken, Rollen, Fermentieren, Zerkleinern und Trocknen bearbeitet werden. Schwarzer Tee ist ein fermentierter Tee, Oolong-Tee ist ein halb fermentierter Tee, dessen Blätter nach Welken u. Rollen nur die Hälfte der sonst üblichen Zeit fermentiert und anschließend getrocknet werden. Grüner Tee ist ein unfermentiertes Erzeugnis, dessen Blätter blanchiert, gerollt und unter Erhalt der natürlichen Blattfarbstoffe getrocknet werden.

Die Zusammensetzung der Inhaltsstoffe der Teeblätter schwankt je nach Herkunft und Behandlung beträchtlich. Im Durchschnitt enthält schwarzer Tee 18,9% Catechine und Catechin-Gerbstoffe, 16,6% Proteine, 2,7% Coffein, 10,2% andere Stickstoffverbindungen, 4,6% Oligosaccharide, 0,6% Stärke, 11,9% Pektin, 7,9% Cellulose und 6,1% Lignin. Frische Blätter weisen im wesentlichen die gleiche Zusammensetzung auf, enthalten jedoch mehr Catechine (26%), weniger Stickstoffverbindungen (8,7%, bei gleichem Coffein-Gehalt) sowie 0,8% Inosit. In den Polyphenol-Gerbstoffen finden sich zu etwa 80% Catechine (Hauptbestandteil Galloyl-(-)-epigallocatechin).

Überraschenderweise wurde gefunden, daß Extrakte aus Blättern der Pflanzen der Ordnung Theales mit der Familie Theaceae, insbesondere der Spezies Camellia spec., ganz besonders der Teesorten Camellia sinenis, C. assamica, C. taliensis bzw. C. irrawadiensis und Kreuzungen aus diesen mit beispielsweise Camellia japonica die

Syntheserate der Ceramide in der menschlichen Haut generell, insbesondere aber die Syntheserate der Ceramide 1, 2 und 3 um ein Vielfaches erhöhen.

Außer den Catechinen (beispielsweise Catechin und Epicatechin) nhält grüner Tee ferner die Gallensäureester dieser Wirkstoffe, welche ebenfalls erfindungsgemäß wirksam sind.

Gegenstand der Erfindung ist ferner die Verwendung von Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen oder wäßriger bzw. organischer Extrakte aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen aufweisen, beispielsweise den Blättern der Pflanzenfamilie Theaceae, insbesondere der Spezies Camellia sinensis (Grüner Tee) bzw. deren typische Inhaltsstoffe (wie z.B. Polyphenole bzw. Catechine, Coffein, Vitamine, Zucker, Mineralien, Aminosäuren, Lipide), zur Stimulierung der Sphingolipidsynthese bzw. zur Stärkung der Lipidbarriere der menschlichen Haut.

Vorteilhaft enthalten erfindungsgemäße Hautpflegeprodukte 0,0001 - 20 Gewichtsprozente an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen oder an wäßrigen bzw. organischen Extrakten aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen aufweisen, vorzugsweise Polyphenole bzw. Catechine aus der Gruppe (-)-Catechin. (+)-Catechin, (-)-Catechingallat, (-)-Gallocatechingallat, (+)-Epicatechin, (-)-Epicatechin, (-)-Epicatechin, (-)-Epigallocatechin, (-)-Epigallocatechingallat.

Bevorzugt enthalten kosmetische oder dermatologische Zubereitungen gemäß der Erfindung 0,001 - 10 Gew.-% an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen oder an wäßrigen bzw. organischen Extrakten aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen aufweisen, bezogen auf die Gesamtzusammensetzung der Zubereitungen.

Ganz besonders bevorzugt enthalten kosmetische oder dermatologische Zubereitungen gemäß der Erfindung 0,01 - 1 Gew.-% an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen oder an wäßrigen bzw. organischen Extrakten aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen aufweisen, bezogen auf die Gesamtzusammensetzung der Zubereitungen.

Die erfindungsgemäßen topischen Zubereitungen können als flüssige, pastöse oder feste Zubereitungen formuliert werden, beispielsweise als wäßrige oder alkoholische Lösungen, wäßrige Suspensionen, Emulsionen, Salben, Cremes, Gele, Öle, Pulver oder Stifte. In Abhängigkeit von der gewünschten Formulierung können Wirkstoffe in pharmazeutische und kosmetische Grundlagen für topische Applikationen eingearbeitet werden, die als weitere Komponenten beispielsweise Ölkomponenten, Fett und Wachse, Emulgatoren, anionische, kationische, ampholytische, zwitterionische und/oder nichtionogene Tenside, niedere ein- und mehrwertige Alkohole, Wasser, Konservierungsmittel, Puffersubstanzen, Verdickungsmittel, Duftstoffe, Farbstoffe und Trübungsmittel enthalten. Vorteilhaft können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe auch in transdermalen therapeutischen Systemen, insbesondere kubischen Systemen verwendet werden.

Es ist von Vorteil, den pflegenden topischen Zubereitungen Zusatzstoffe wie Vitamine, Coenzyme, Substrate und Hilfsfaktoren des Lipidstoffwechsels oder des Energiestoffwechsels oder sonstige kosmetische oder dermatologische Hilfs- oder Wirkstoffe zuzusetzen, beispielsweise Pyridoxin, Pyridoxal, Pyridoxamin, Uridin, L-Serin, schwache Carbonsäuren, deren pKs-Wert zwischen 3 und 5,5 liegt (z.B. Milchsäure und Propionsäure), Citronensäure, Pyruvat sowie zelluläre Energieüberträger (z.B. Kreatin, Guanin, Guanosin, Adenin, Adenosin, Nicotin, Nicotinamid, Riboflavin), Coenzyme (z.B. Coenzym Q₁₀, Pantothensäure, Panthenol, Liponsäure), Hilfsfaktoren (z.B. L-Carnitin), Substrate (z.B. Hexosen, Pentosen, Fettsäuren), Taurocholsäure, Lipide (z.B. Ceramide, Cholesterin, Fettsäuren, Sphinosin, Sphingomyelin, Glucocerebroside), Substrate (z.B. Hexosen, Pentosen, Fettsäuren), Glutathion und/oder natürliche Befeuchtungsfaktoren (z.B. Aminosäuren, Harnstoff, Pyrrolidoncarbonsäure, Glycerin).

Es ist auch von Vorteil, den erfindungsgemäßen Zubereitungen Antioxidantien zuzusetzen. Vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z.B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z.B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D.L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z.B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z.B. α-Carotin, β-Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Chlorogensäure und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z.B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z.B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-, y-Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodi-

propionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z.B. Buthioninsulfoximine, Homocysteinsulfoximin, Buthioninsulfone, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z.B. pmol bis umol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z.B. α-Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin), α-Hydroxysäuren (z.B. Citronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z.B. y-Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Ubichinon und Ubichinol und deren Derivate, Vitamin C und Derivate (z.B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z.B. Vitamin-E-acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin-A-palmitat) sowie Koniferylbenzoat des Benzoeharzes, Rutinsäure und deren Derivate, α-Glycosylrutin, Ferulasäure, Furfurylidenglucitol, Carnosin, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajaretsäure. Trihydroxybutyrophenon, Hamsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z.B. ZnO, ZnSO₄) Selen und dessen Derivate (z.B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z.B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

Günstig sind auch solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmittels vorliegen. Vorzugsweise enthalten diese neben den erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen zusätzlich mindestens eine UV-A-Filtersubstanz und/oder mindestens ein anorganisches Pigment.

Es ist aber auch vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindungen, solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen zu erstellen, deren hauptsächlicher Zweck nicht der Schutz vor Sonnenlicht ist, die aber dennoch einen Gehalt an UV-Schutzsubstanzen enthalten. So werden z.B. in Tagescremes gewöhnlich UV-A- bzw. UV-B-Filtersubstanzen eingearbeitet.

Auch stellen UV-Schutzsubstanzen, ebenso wie Antioxidantien und, gewünschtenfalls, Konservierungsstoffe, einen wirksamen Schutz der Zubereitungen selbst gegen Verderb dar.

Vorteilhaft können erfindungsgemäße Zubereitungen außerdem Substanzen enthalten, die UV-Strahlung im UVB-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z.B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 10 Gew.-%, insbesondere 1,0 bis 6,0 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, um kosmetische Zub reitungen zur Verfügung zu stellen, die das Haar bzw. die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel fürs Haar oder die Haut dienen.

Enthalten die erfindungsgemäßen Zubereitungen UVB-Filtersubstanzen, können diese öllöslich oder wasserlöslich sein. Erfindungsgemäß vorteilhafte öllösliche UVB-Filter sind z.B.:

- 3-Benzylidencampher-Derivate, vorzugsweise 3-(4-Methylbenzyliden)campher,
 3-Benzylidencampher;
- 4-Aminobenzoësäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoësäure-(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoësäureamylester;
- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;
- Ester der Salicylsäure, vorzugsweise Salicylsäure(2-ethylhexyl)ester, Salicylsäure(4-isopropylbenzyl)ester, Salicylsäurehomomenthylester,
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon;
- Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmalonsäuredi(2ethylhexyl)ester,
- Derivate des 1,3,5-Triazins, vorzugsweise 2,4,6-Trianilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy) -1,3,5-triazin.

Die Liste der genannten UVB-Filter, die in Kombination mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen verwendet werden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

Es kann auch von Vorteil sein, erfindungsgemäße Zubereitungen mit UVA-Filtem zu formulieren, die bisher üblicherweise in kosmetischen Zubereitungen enthalten sind. Bei diesen Substanzen handelt es sich vorzugsweise um Derivate des Dibenzoylmethans, insbesondere um 1-(4'-tert.Butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propan-1,3-dion und um 1-Phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)propan-1,3-dion.

Gegenstand der Erfindung sind also auch die Kombinationen der erfindungsgemäßen Wirkstoffe, insbesondere in den topischen Zubereitungen, mit Antioxidantien, Stoffen des aeroben zellulären Energiestoffwechsels und/oder UV-Absorbern, durch die sich z.B. die Stabilität und die Wirkung der Zubereitung verbessern läßt.

Die vorstehend aufgeführten Beispiele für kombinierbare Wirkstoffe aus den angegebenen Wirkstoffgruppen dienen dazu, die Erfindung zu beschreiben, ohne daß beabsichtigt ist, die Erfindung auf diese Beispiele zu beschränken.

Darüber hinaus können schützende Formulierungsformen angewendet werden, wobei die erfindungsgemäßen Stoffe z.B. in Liposomen, Micellen, Nanosphären usw. aus z.B. hydrierten Amphiphilen, wie z.B. Ceramiden, Fettsäuren, Sphingomyelin und Phosphoglyceriden bzw. in Cyclodextrane eingeschlossen (verkapselt) werden. Weiterer Schutz kann durch die Verwendung von Schutzgas (z.B. N₂, CO₂) bei der Formulierung und die Verwendung gasdichter Verpackungsformen erreicht werden.

Weitere Hilfs- und Zusatzstoffe können wasserbindende Stoffe, Verdicker, Füllstoffe, Parfüm, Farbstoffe, Emulgatoren, Wirkstoffe wie Vitamine, Konservierungsmittel, Wasser und/oder Salze sein.

Die erfindungsgemäßen Stoffgruppen lassen sich in alle kosmetischen Grundlagen einarbeiten. Grundsätzlich sind allerdings W/O- und O/W- und W/O/W-Emulsionen, Hydrodispersionen und Lipodispersionen bevorzugt. Besonders vorteilhaft können erfindungsgemäße Kombinationen in Pflegeprodukte wie beispielsweise O/W-Cremes, W/O-Cremes, O/W-Lotionen usw. eingesetzt werden.

Die Lipidphase kann vorteilhaft gewählt werden aus folgender Substanzgruppe:

- Mineralöle, Mineralwachse
- Öle, wie Triglyceride der Caprin- oder der Caprylsäure, vorzugsweise aber Rizinusöl;
- Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z.B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettalkoholen mit Alkansäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren;
- Alkylbenzoate;

Silikonöle wie Dimethylpolysiloxane, Diethylpolysiloxane, Diphenylpolysiloxan sowie Mischformen daraus.

Die Ölphase der Emulsionen, Oleogele bzw. Hydrodispersionen oder Lipodispersionen im Sinne der vorliegenden Erfindung wird vorteilhaft gewählt aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen und gesättigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen, aus der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen. Solche Esteröle können dann vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Isopropylstearat, Isopropyloleat, n-Butylstearat, n-Hexyllaurat, n-Decyloleat, Isooctylstearat, Isononylstearat, Isononylisononanoat, 2-Ethylhexylpalmitat, 2-Ethylhexyllaurat, 2-Hexyldecylstearat, 2-Octyldodecylpalmitat, Oleyloleat, Oleylerucat, Erucyloleat, Erucylorucat, sowie synthetische, halbsynthetische und natürliche Gemische solcher Ester, z.B. Jojobaöl.

Ferner kann die Ölphase vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Kohlenwasserstoffe und -wachse, der Silkonöle, der Dialkylether, der Gruppe der gesättigten oder ungesättigten, verzweigten oder unverzweigten Alkohole, sowie der Fettsäuretriglyceride, namentlich der Triglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12 - 18 C-Atomen. Die Fettsäuretriglyceride können beispielsweise vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der synthetischen, halbsynthetischen und natürlichen Öle, z.B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaöl, Erdnußöl, Rapsöl, Mandelöl, Palmöl, Kokosöl, Palmkernöl und dergleichen mehr.

Auch beliebige Abmischungen solcher Öl- und Wachskomponenten sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung einzusetzen. Es kann auch gegebenenfalls vorteilhaft sein, Wachse, beispielsweise Cetylpalmitat, als alleinige Lipidkomponente der Ölphase einzusetzen.

Vorteilhaft wird die Ölphase gewählt aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisononanoat, Isoeicosan, 2-Ethylhexylcocoat, C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat, Capryl-Caprinsäure-triglycerid, Dicaprylylether.

Besonders vorteilhaft sind Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat und 2-Ethylhexylisostearat, Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat und Isotridecylisononanoat sowie Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat, 2-Ethylhexylisostearat und Isotridecylisononanoat.

Von den Kohlenwasserstoffen sind Paraffinöl, Squalan und Squalen vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden.

Vorteilhaft kann die Ölphase ferner einen Gehalt an cyclischen oder linearen Silikonölen aufweisen oder vollständig aus solchen Ölen bestehen, wobei allerdings bevorzugt wird, außer dem Silikonöl oder den Silikonölen einen zusätzlichen Gehalt an anderen Ölphasenkomponenten zu verwenden.

Vorteilhaft wird Cyclomethicon (Octamethylcyclotetrasiloxan) als erfindungsgemäß zu verwendendes Silikonöl eingesetzt. Aber auch andere Silikonöle sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden, beispielsweise Hexamethylcyclotrisiloxan, Polydimethylsiloxan, Polydmethylphenylsiloxan).

Besonders vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisononanoat, aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

Die wäßrige Phase der erfindungsgemäßen Zubereitungen enthält gegebenenfalls vorteilhaft

Alkohole, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte, ferner Alkohole niedriger C-Zahl, z.B. Ethanol,
Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin sowie insbesondere ein oder mehrere
Verdickungsmittel, welches oder welche vorteilhaft gewählt werden können
aus der Gruppe Siliciumdioxid, Aluminiumsilikate, Polysaccharide bzw. deren
Derivate, z.B. Hyaluronsäure, Xanthangummi, Hydroxypropylmethylcellulose,
besonders vorteilhaft aus der Gruppe der Polyacrylate, bevorzugt ein Polyacrylat aus der Gruppe der sogenannten Carbopole, beispielsweise Carbopole der Typen 980, 981, 1382, 2984, 5984, jeweils einzeln oder in Kombination.

Im technischen Sinne werden unter Gelen verstanden: Relativ formbeständige, leicht verformbare disperse Systeme aus zumindest zwei Komponenten, welche in der Regel aus einem - meist festen - kolloid zerteilten Stoff aus langkettigen Molekülgruppierungen (z.B. Gelatine, Kieselsäure, Polysaccharide) als Gerüstbildner und einem flüssigen Dispersionsmittel (z.B. Wasser) bestehen. Der kolloidal zerteilte Stoff wird oft als Verdickungs- oder Geliermittel bezeichnet. Er bildet ein räumliches Netzwerk im Dispersionsmittel, wobei einzelne kolloidal vorliegende Partikel über elektrostatische Wechselwirkung miteinander mehr oder weniger fest verknüpft sein können. Das Dispersionsmittel, welches das Netzwerk umgibt, zeichnet sich durch elektrostatische Affinität zum Geliermittel aus, d.h., ein vorwiegend polares (insbesondere: hydrophiles) Geliermittel geliert vorzugsweise ein polares Dispersionsmittel (insbesondere: Wasser), wohingegen ein vorwiegend unpolares Geliermittel vorzugsweise unpolare Dispersionsmittel geliert.

Starke elektrostatische Wechselwirkungen, welche beispielsweise in Wasserstoffbrükkenbindungen zwischen Geliermittel und Dispersionsmittel, aber auch zwischen Dispersionsmittelmolekülen untereinander verwirklicht sind, können zu starker Vernetzung auch des Dispersionsmittels führen. Hydrogele können zu fast 100 % aus Wasser bestehen (neben beispielsweise ca. 0,2 - 1,0 % eines Geliermittels) und dabei durchaus feste Konsistenz besitzen. Der Wasseranteil liegt dabei in eisähnlichen Strukturelementen vor, so daß Gele daher ihrer Namensherkunft [aus lat. "gelatum" = "Gefrorenes" über den alchimistischen Ausdruck "gelatina" (16. Jhdt.) für nhdt. "Gelatine"] durchaus gerecht werden.

Gele gemäß der Erfindung enthalten üblicherweise Alkohole niedriger C-Zahl, z.B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin und Wasser in Gegenwart eines Verdickungsmittels, das bei ölig-alkoholischen Gelen vorzugsweise Siliciumdioxid oder ein Aluminiumsilikat, bei wäßrig-alkoholischen oder alkoholischen Gelen vorzugsweise ein Polyacrylat ist.

Zubereitungen gemäß der Erfindung können beispielsweise auch als Schaum- und Duschbäder, feste und flüssige Seifen oder sogenannte "Syndets" (synthetische Detergentien), Shampoos, Handwaschpasten, Intimwaschmittel, spezielle Reinigungsmittel für Kleinkinder und dergleichen ausgestaltet werden.

Erfindungsgemäße Zubereitungen könn in sich gegebenenfalls vorteilhaft durch einen Gehalt an Tensiden auszeichnen. Tenside sind amphiphile Stoffe, die organische, unpolare Substanzen in Wasser lösen können. Sie sorgen, bedingt durch ihren spezifischen Molekülaufbau mit mindestens einem hydrophilen und einem hydrophoben Molekülteil, für eine Herabs tzung der Oberflächenspannung des Wassers, die Benetzung der Haut, die Erleichterung der Schmutzentfernung und -lösung, ein leichtes Abspülen und - je nach Wunsch – für Schaumregulierung.

Bei den hydrophilen Anteilen eines Tensidmoleküls handelt es sich meist um polare funktionelle Gruppen, beispielweise –COO, –OSO₃², –SO₃, während die hydrophoben Teile in der Regel unpolare Kohlenwasserstoffreste darstellen. Tenside werden im allgemeinen nach Art und Ladung des hydrophilen Molekülteils klassifiziert. Hierbei können vier Gruppen unterschieden werden:

- anionische Tenside,
- · kationische Tenside,
- amphotere Tenside und
- · nichtionische Tenside.

Anionische Tenside weisen als funktionelle Gruppen in der Regel Carboxylat-, Sulfatoder Sulfonatgruppen auf. In wäßriger Lösung bilden sie im sauren oder neutralen Milieu negativ geladene organische Ionen. Kationische Tenside sind beinahe ausschließlich durch das Vorhandensein einer quarternären Ammoniumgruppe gekennzeichnet. In wäßriger Lösung bilden sie im sauren oder neutralen Milieu positiv geladene organische Ionen. Amphotere Tenside enthalten sowohl anionische als auch kationische Gruppen und verhalten sich demnach in wäßriger Lösung je nach pH-Wert wie anionische oder kationische Tenside. Im stark sauren Milieu besitzen sie eine positive und im alkalischen Milieu eine negative Ladung. Im neutralen pH-Bereich hingegen sind sie zwitterionisch, wie das folgende Beispiel verdeutlichen soll:

| RNH2 CH2CH2COOH X | (bei pH=2) | X = beliebiges Anion, z.B. Cl |
|-------------------|-------------|----------------------------------|
| RNH₂*CH₂CH₂COO* | (bei pH=7) | |
| RNHCH2CH2COO B* | (bei pH=12) | B* = beliebiges Kation, z.B. Na* |

Typisch für nicht-ionische Tenside sind Polyether-Ketten. Nicht-ionische Tenside bilden in wäßrigem Medium keine Ionen.

A. Anionische Tenside

Vorteilhaft zu verwendend anionische Tenside sind

Acylaminosäuren (und der n Salze), wie

- 1. Acylglutamate, beispielsweise Natriumacylglutamat, Di-TEA-palmitoylaspartat und Natrium Caprylic/ Capric Glutamat,
- Acylpeptide, beispielsweise Palmitoyl-hydrolysiertes Milchprotein, Natrium Cocoyl-hydrolysiertes Soja Protein und Natrium-/ Kalium Cocoyl-hydrolysiertes Kollagen,
- 3. Sarcosinate, beispielsweise Myristoyl Sarcosin, TEA-lauroyl Sarcosinat, Natriumlauroylsarcosinat und Natriumcocoylsarkosinat,
- 4. Taurate, beispielsweise Natriumlauroyltaurat und Natriummethylcocoyltaurat,
- 5. AcylLactylate, lauroyllactylat, Caproyllactylat
- 6. Alaninate

Carbonsäuren und Derivate, wie

- Carbonsäuren, beispielsweise Laurinsäure, Aluminiumstearat, Magnesiumalkanolat und Zinkundecylenat,
- Ester-Carbonsäuren, beispielsweise Calciumstearoyllactylat, Laureth-6 Citrat und Natrium PEG-4 Lauramidcarboxylat,
- Ether-Carbonsäuren, beispielsweise Natriumlaureth-13 Carboxylat und Natrium PEG-6 Cocamide Carboxylat,

Phosphorsäureester und Salze, wie beispielsweise DEA-Oleth-10-Phosphat und Dilaureth-4 Phosphat,

Sulfonsäuren und Salze, wie

- 1. Acyl-isethionate, z.B. Natrium-/ Ammoniumcocoyl-isethionat,
- 2. Alkylarylsulfonate,
- Alkylsulfonate, beispielsweise Natriumcocosmonoglyceridsulfat, Natrium C₁₂₋₁₄
 Olefin-sulfonat, Natriumlaurylsulfoacetat und Magnesium PEG-3 Cocamidsulfat,
- Sulfosuccinate, beispielsweise Dioctylnatriumsulfosuccinat, Dinatriumlaurethsulfosuccinat, Dinatriumlaurylsulfosuccinat und Dinatriumundecylenamido MEA-Sulfosuccinat

sowie

Schwefelsäureester, wie

- 1. Alkylethersulfat, beispielsweise Natrium-, Ammonium-, Magnesium-, MIPA-, Ti-PA- Laurethsulfat, Natriummyrethsulfat und Natrium C₁₂₋₁₃ Parethsulfat,
- 2. Alkylsulfate, beispielsweise Natrium-, Ammonium- und TEA- Laurylsulfat.

B. Kationische Tenside

Gegebenenfalls vorteilhaft zu verwendende kationische Tenside sind

- Alkylamine,
- 2. Alkylimidazole,
- 3. Ethoxylierte Amine und
- 4. Quaternäre Tenside.
- 5. Esterquats

Quatemäre Tenside enthalten mindestens ein N-Atom, das mit 4 Alkyl- oder Arylgruppen kovalent verbunden ist. Dies führt, unabhängig vom pH Wert, zu einer positiven Ladung. Vorteilhaft sind, Alkylbetain, Alkylamidopropylbetain und Alkyl-amidopropylhydroxysulfain. Die erfindungsgemäß verwendeten kationischen Tenside können ferner bevorzugt gewählt werden aus der Gruppe der quaternären Ammoniumverbindungen, insbesondere Benzyltrialkylammoniumchloride oder -bromide, wie beispielsweise Benzyldimethylstearylammoniumchlorid, ferner Alkyltrialkylammoniumsalze, beispielsweise beispielsweise Cetyltrimethylammoniumchlorid oder -bromid, Alkyldimethylhydroxyethylammoniumchloride oder -bromide, Dialkyldimethylammoniumchloride oder -bromide, Alkylamidethyltrimethylammoniumethersulfate, Alkylpyridiniumsalze, beispielsweise Lauryl- oder Cetylpyrimidiniumchlorid, Imidazolinderivate und Verbindungen mit kationischem Charakter wie Aminoxide, beispielsweise Alkyldimethylaminoxide oder Alkylaminoethyldimethylaminoxide. Vorteilhaft sind insbesondere Cetyltrimethylammoniumsalze zu verwenden.

C. Amphotere Tenside

Vorteilhaft zu verwendende amphotere Tenside sind

- Acyl-/dialkylethylendiamin, beispielsweise Natriumacylamphoacetat, Dinatriumacylamphodipropionat, Dinatriumalkylamphodiacetat, Natriumacylamphohydroxypropylsulfonat, Dinatriumacylamphodiacetat und Natriumacylamphopropionat,
- N-Alkylaminosäuren, beispielsweise Aminopropytalkylglutamid, Alkylaminopropionsäure, Natriumalkylimidodipropionat und Lauroamphocarboxyglycinat.

D. Nicht-ionische Tenside

Vorteilhaft zu verwendende nicht-ionische Tenside sind

- 1. Alkohole,
- 2. Alkanolamide, wie Cocamide MEA/ DEA/ MIPA,
- 3. Aminoxide, wie Cocoamidopropylaminoxid,
- 4. Ester, die durch Veresterung von Carbonsäuren mit Ethylenoxid, Glycerin, Sorbitan oder ander in Alkoholen entstehen,
- 5. Ether, beispielsweise ethoxylierte/propoxylierte Alkohole, ethoxylierte/ propoxylierte Ester, ethoxylierte/ propoxylierte Glycerinester, ethoxylierte/ propoxylierte Cholesterine, ethoxylierte/ propoxylierte Triglyceridester, ethoxyliertes propoxyliertes Lanolin, ethoxylierte/ propoxylierte Polysiloxane, propoxylierte POE-Ether und Alkylpolyglycoside wie Laurylglucosid, Decylglycosid und Cocoglycosid.
- 6. Sucroseester, -Ether
- 7 Polyglycerinester, Diglycerinester, Monoglycerinester
- 8. Methylglucosester, Ester von Hydroxysäuren

Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen. Mengenangaben, Prozentangaben oder Teile beziehen sich, soweit nicht anders angegebene, auf das Gewicht, insbesondere auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen oder der jeweiligen Mischung.

Hautcreme vom W/O-Typ

| | Gew% |
|---|-----------|
| Vaseline DAB 9 | 13,0 |
| Glycerin DAB 9 | 6,30 |
| Paraffinöl | 40,80 |
| Cetylstearylalkohol/PEG-40-Ricinusöl/Natriumcetyl | 2,50 |
| stearylsulfat | |
| (Eutanol® G, Henkel KGaA) | |
| Extrakt von grünem Tee | 3,00 |
| Parfum, Konservierungsmittel, Farbstoffe | q.s. |
| Wasser | ad 100,00 |

Der Extrakt von grünem Tee wird in die Wasserphase eingerührt. Die Fettphase wird zu der 75° C warmen Wasserphase gegeben, verrührt und homogenisiert, bis eine gleichmäßige Creme entstanden ist.

Beispiel 2

Hautcreme vom W/O-Typ

| | Gew% |
|--|-----------|
| PEG-1 Glyceryl-Oleostearat + Paraffinwachs | 8,00 |
| Vaseline DAB | 2,80 |
| Paraffinwachs/Paraffin | 1,80 |
| Paraffinöl | 12,00 |
| Ceresin | 2,20 |
| Octyldodecanol | 10,00 |
| Propylenglycol | 1,00 |
| Glycerin | 1,00 |
| Magnesiumsulfat | 0,70 |
| Parfum, Konservierungsmittel, Farbstoffe | q.s. |
| Wasser VES | ad 100,00 |

Der Extrakt von grünem Tee wird in die Wasserphase eingerührt. Die Fettphase wird zu der 75° C warmen Wasserphase gegeben, verrührt und homogenisiert, bis eine gleichmäßige Creme entstanden ist.

Hautcreme vom O/W-Typ

| | Gew% |
|--|-----------|
| Octyldodecanol | 9,30 |
| (Emulgade ® F, Henkel KGaA) | |
| Cetearylalkohol/PEG-40-Paraffinöl | 7,80 |
| Ricinusöl/Natriumcetearylsulfat | 3,70 |
| (Eutanol ® G, Henkel KGaA) | |
| (-)-Epigallocatechin Gallat | 1,00 |
| Glycerin DAB 9 | 4,50 |
| Parfum, Konservierungsmittel, Farbstoffe | q.s. |
| Wasser VES | ad 100,00 |

(-)-Epigallocatechin Gallat wird in der Wasserphase gelöst. Die Fettphase wird zu der 75°C warmen Wasserphase gegeben, verrührt und homogenisiert, bis eine gleichmäßige Creme entstanden ist.

Beispiel 4

O/W-Lotion

| | Gew% |
|--|-----------|
| Steareth-2 | 3,00 |
| Steareth-21 | 2,00 |
| Cetylstearylalkohol/TEG-40-Ricinusöl/Natriumcetyl- | 2,50 |
| stearylsulfat | |
| (Eutanol ® G, Henkel KGaA) | |
| Paraffinöl | 15,00 |
| Propylenglycol | 1,00 |
| Glycerin | 3,00 |
| (-)-Catechin | 1,20 |
| Parfum, Konservierungsmittel, Farbstoffe | q.s. |
| Wasser VES | ad 100,00 |

(-)-Catechin wird in der Wasserphase gelöst. Die Fettphase wird sodann zu der 75° C warmen Wasserphase gegeben, verrührt und homogenisiert, bis eine gleichmäßige hellgelbe Lotion entstanden ist.

Hautcreme vom O/W-Typ

| | Gew% |
|--|-----------|
| Octyldodecanol | 9,30 |
| (Emulgade ® F. Henkel KGaA) | |
| Cetearylalkohol/PEG-40-Paraffinöl | 7,80 |
| Ricinusöl/Natriumcetearylsulfat | 3,70 |
| (Eutanol ® G, Henkel KGaA) | |
| (-)-Epigallocatechin Gallat | 1,00 |
| Glycerin DAB 9 | 4,50 |
| Parfum, Konservierungsmittel, Farbstoffe | q.s. |
| Wasser VES | ad 100,00 |

(-)-Epigallocatechin Gallat wird in der Wasserphase gelöst. Die Fettphase wird zu der 75°C warmen Wasserphase gegeben, verrührt und homogenisiert, bis eine gleichmäßige Creme entstanden ist.

Beispiel 4

O/W-Lotion

| | Gew% |
|--|-----------|
| Steareth-2 | 3,00 |
| Steareth-21 | 2,00 |
| Cetylstearylalkohol/TEG-40-Ricinusöl/Natriumcetyl- | 2,50 |
| stearylsülfat | |
| (Eutanol ® G, Henkel KGaA) | |
| Paraffinöl | 15,00 |
| Propylenglycol | 1,00 |
| Glycerin | 3,00 |
| (-)-Catechin | 1,20 |
| Parfum, Konservierungsmittel, Farbstoffe | q.s. |
| Wasser VES | ad 100,00 |

(-)-Catechin wird in der Wasserphase gelöst. Die Fettphase wird sodann zu der 75° C warmen Wasserphase gegeben, verrührt und homogenisiert, bis eine gleichmäßige hellgelbe Lotion entstanden ist.

O/W-Lotion

| | Gew,-% |
|--|-----------|
| Octyldodecanol | 5,60 |
| (Emulgade F, Henkel KGaA) | |
| Cetylstearylalkohol/TEG-40-Ricinusöl/Natriumcetyl- | 8,90 |
| stearylsulfat | |
| (Eutanol ® G, Henkel KGaA) | |
| Cetearylisononanoat | 7,50 |
| (Cetiol® 5N, Henkel KGaA) | |
| Paraffinöl | 10,50 |
| (-)-Gallocatechin Gallat | 5,00 |
| Glycerin DAB 9 | 4,70 |
| Parfum, Konservierungsmittel, Farbstoffe | q.s. |
| Wasser VES | ad 100,00 |

(-)-Gallocatechin Gallat wird in der Wasserphase gelöst, Die Fettphase wird sodann zu der 75° C warmen Wasserphase gegeben, verrührt und homogenisiert, bis eine gleichmäßige Emulsion entstanden ist.

Beispiel 6

Hautöl

| | Gew% |
|--------------------------------|-------|
| Glyceryltricaprylat | 21,00 |
| (Miglyol ® 812, Dynamit Nobel) | |
| Hexyllaurat | 20,00 |
| (Cetiol ® A, Henkel KGaA) | |
| Octylstearat | 20,00 |
| (Cetiol ® 886, Henkel KGaA | |
| Paraffinöl | 36,00 |
| Extrakt von grünem Tee | 3,00 |

Die Komponenten werden bei 25° C verrührt, bis eine gleichmäßige, klare Mischung entstanden ist.

Patentansprüche:

- 1. Verwendung von Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen oder wäßriger bzw. organischer Extrakte aus Pflanzen oder Pflanzent ilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen aufweisen, beispielsweise den Blättern der Pflanzenfamilie Theaceae, insbesondere der Spezies Camellia sinensis (grüner Tee) bzw. deren typische Inhaltsstoffe (wie z.B. Polyphenole bzw. Catechine, Coffein, Vitamine, Zucker, Mineralien, Aminosäuren, Lipide), zur Prophylaxe, Behandlung und/oder Pflege trockener Hautzustände.
- 2. Verwendung von Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen oder wäßriger bzw. organischer Extrakte aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen aufweisen, beispielsweise den Blättern der Pflanzenfamilie Theaceae, insbesondere der Spezies Camellia sinensis (Grüner Tee) bzw. deren typische Inhaltsstoffe (wie z.B. Polyphenole bzw. Catechine, Coffein, Vitamine, Zucker, Mineralien, Aminosäuren, Lipide), zur Stimulierung der Sphingolipidsynthese bzw. zur Stärkung der Lipidbarriere der menschlichen Haut.
- 3. Verwendung nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß das oder die Catechine gewählt wird oder werden aus der Gruppe (-)-Catechin, (+)-Catechin, (-)-Catechin Gallat, (-)-Gallocatechin Gallat, (+)-Epicatechin, (-)-Epicatechin Gallat, (-)-Epigallocatechin, (-)-Epigallocatechin Gallat.
- 4. Verwendung nach Ansprüch 1 oder 2, in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen enthaltend pflanzliche Auszüge mit einem Gehalt an Catechinen, insbesondere solchen Zubereitungen, die Extrakte des grünen Tees enthalten.

MILLIAMINITUTAL SEARCH REPURI

Inte onal Application No PCT/EP 99/03777

| A. CLASSI IPC 6 | FICATION OF SUBJECT MATTER A61K7/48 | | |
|--|--|---|---|
| According to | o International Patent Classification (IPC) or to both national classificat | ion and IPC | - |
| B. FIELDS | SEARCHED | | |
| Minimum do IPC 6 | ocumentation searched (classification system followed by classification A61K | n symbols) | |
| Documental | tion searched other than minimum documentation to the extent that suc | ch documents are included in the fields se | arched |
| Electrónic d | ata base consulted during the international search (name of data base | e and, where practical, search terms used) | |
| C. DOCUM | ENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT | | |
| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relev | vant passages | Relevant to claim No. ' |
| A | DE 196 27 344 A (VITASYN GMBH ENTE & VERTRIEB PHARMAZEUTISCHER PRODUK 8 January 1998 (1998-01-08) the whole document | | |
| Α | WO 98 10739 A (E-L MANAGEMENT COMET AL.) 19 March 1998 (1998-03-19) page 4, line 8 - line 31 | | |
| Funt | her documents are listed in the continuation of box C. | X Patent family members are listed in | annex. |
| "A" docume consid "E" earlier of filing d "L" docume which citation "O" docume other of the country of the coun | ent defining the general state of the art which is not lered to be of particular relevance document but published on or after the international late which may throw doubts on priority claim(s) or is cited to establish the publication date of another nor other special reason (as specified) ent referring to an oral disclosure, use, exhibition or means and published prior to the international filing date but | T later document published after the inter or priority date and not in conflict with t cited to understand the principle or the invention X document of particular relevance; the cit cannot be considered novel or cannot involve an inventive step when the doc of document of particular relevance; the cit cannot be considered to involve an inventive and the considered to involve and the considered to involve an inventive and the considered to involve an inventive and the considered to involve an | he application but ony underlying the aimed invention ne considered to unment is taken alone, aimed invention entive step when the a other such docu- s to a person skilled |
| 1 | 1 October 1999 | 18/10/1999 | |
| Name and n | nailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl. Fax: (+31-70) 340-3016 | Authorized officer Alvarez Alvarez, C | , |

MILENIALIUMAL SEARCH REFURI

information on patent family members

Inte 'lonal Application No PCT/EP 99/03777

| Patent document cited in search report | | Publication date | i | Patent family member(s) | | Publication date | |
|---|---|------------------|----------|----------------------------|--------|--------------------------|---|
| DE 19627344 | Α | 08-01-1998 | DE | 29623606 | U | 10-06-1999 | - |
| WO 9810739 | A | 19-03-1998 | US AU | 5855897 4481897 | A A | 05-01-1999 02-04-1998 | |

Form PCT/ISA/210 (patent femily annex) (July 1992)

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Inte ionales Aktenzeichen
PCT/EP 99/03777

| A. KLASSI IPK 6 | Fizierung des anmeldungsgegenstandes A61K7/48 | | | | | | | | | |
|--|--|--|-----|--|--|--|--|--|--|--|
| Nach der Int | ternationalen Patentklassifikation (IPK) öder nach der nationalen Klas | silikation und der IPK. | - | | | | | | | |
| B. RECHERCHIERTE GEBIETE | | | | | | | | | | |
| Recherchier IPK 6 | ner Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbo A61K | le) | | | | | | | | |
| Recherchier | te aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, so | weit diese unter die recherchierten Gebiete fallen | | | | | | | | |
| Während de | r internationalen Recherche konsultierte elektronische Dalenbank (N | ame der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) | | | | | | | | |
| C. ALS WE | SENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN | | | | | | | | | |
| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe | e der in Betracht kommenden Teile. Betr. Anspruch | Nr. | | | | | | | |
| A | DE 196 27 344 A (VITASYN GMBH ENT & VERTRIEB PHARMAZEUTISCHER PRODU 8. Januar 1998 (1998-01-08) das ganze Dokument | | | | | | | | | |
| A | WO 98 10739 A (E-L MANAGEMENT CO ET AL.) 19. März 1998 (1998-03-19 Seite 4, Żeile 8 - Zeile 31 | | | | | | | | | |
| | | | | | | | | | | |
| | ere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu ehmen | X Siehe Anhang Patentfamilie | | | | | | | | |
| *Besondere *A* Veröfter aber n *E* älteres l Anmel *L* Veröfter schein andere *O* Veröfter eine B *P* Veröfter dem b | rer Kategörien von angegebenen Verölfentlichungen lentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist s Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen seldedatum verölfentlicht worden ist lentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhalt er- sinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer eren im Recherchenbericht genannten Verölfentlichung belegt werden ober die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie pelührt) lentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht fenllichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichung die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlichtung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichung, die sich auf eine mit enternationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlichtung von der norder mit zum Verständnis das der Anmeldung nich kölfidert, sondern nur zum Verständnis des der Anmeldung zugundellegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist "X" Veröffentlichung, die sech dem internationalen Anmeldedatum kann alein aufgrund dieser Veröffentlichung; die beanspruchte Erfindung veröffentlichung on besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung veröffentlichung on besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung veröffentlichung en besonderer Tätigkeit beruhend betrachtet veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen veröffentlichung, die veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen veröffentlichung, die veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen veröffentlichung, die der veröffe | | | | | | | | | |
| Dalum des / | Abschlusses der internationalen Recherche | Absendedalum des internationalen Recherchenberichts | | | | | | | | |
| 1 | 1. Oktober 1999 | 18/10/1999 | | | | | | | | |
| Name und F | Postanschnit der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL – 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040. Tx. 31 651 epo nl. | Bevollmächtigter Bediensteter | | | | | | | | |
| | Fax: (+31-70) 340-3016 | Alvarez Alvarez, C | | | | | | | | |

INTERNATIONALER RECHEKCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichu. ...n. die zur selben Patentlamilie gehören

Inte onales Aktenzeichen
PCT/EP 99/03777

| Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument | | Datum der Veröffentlichung | Mitglied(er) der Patentfamilie | | Datum der Veröffentlichung | |
|---|---|-------------------------------|-----------------------------------|--------------------|-------------------------------|--------------------------|
| DE 19627344 | Α | 08-01-1998 | DE | 29623606 | U | 10-06-1999 |
| WO 9810739 | Α | 19-03-1998 | US AU | 5855897 4481897 | A A | 05-01-1999 02-04-1998 |

Formblatt PCT/ISA/210 (Anhang Patentlamilie) (Juli 1992)